

12

DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

A1

22 Date de dépôt : 10.04.98.

30 Priorité :

43 Date de mise à la disposition du public de la
demande : 15.10.99 Bulletin 99/41.

56 Liste des documents cités dans le rapport de
recherche préliminaire : *Se reporter à la fin du
présent fascicule*

60 Références à d'autres documents nationaux
apparentés :

71 Demandeur(s) : LVMH RECHERCHE Groupement
d'intérêt économique — FR.

72 Inventeur(s) : MEYBECK ALAIN.

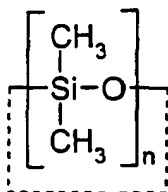
73 Titulaire(s) :

74 Mandataire(s) : CABINET BEAU DE LOMENIE.

54 COMPOSITIONS COSMÉTIQUES OU DERMATOLOGIQUES SOUS FORME D'ÉMULSIONS DE TYPE EAU-DANS-HUILE RENFERMANT DES CYCLOMÉTHICONES ET DES PHOSPHOLIPIDES ET LEUR PROCÉDE DE PRÉPARATION.

57 L'invention concerne des compositions cosmétiques ou dermatologiques pour application topique, sous forme d'émulsions eau-dans-huile.

Ces compositions contiennent, en poids:
- 1 à 50 %, de préférence 3 à 20 %, d'une cyclométhicone répondant à la formule générale:



dans laquelle n est compris entre 3 et 6 et de préférence égal à 4 ou 5, ou d'un mélange de cyclométhicones,

- 0,5 à 30 %, de préférence 1 à 15 %, d'un hydrocarbure liquide en C₆ à C₄₀, d'un ester liquide d'acide gras et d'alcool gras ou d'un mélange de tels hydrocarbures et/ ou es-

ters,

- 1 à 50 %, de préférence 4 à 30 %, d'un phospholipide naturel ou d'un mélange de phospholipides naturels,

- 40 à 90 %, de préférence 60 à 90 %, d'eau.

Elles présentent l'avantage de pouvoir être utilisées pour véhiculer des actifs ainsi bien hydrosolubles que liposolubles.

FR 2 777 181 - A1



La présente invention concerne de nouvelles compositions
 5 cosmétiques ou dermatologiques pour application topique, sous forme d'émulsions
 de type eau-dans-huile, renfermant des cyclométhicones et des phospholipides et
 leur procédé de préparation.

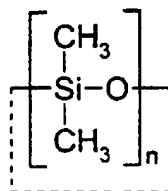
Les formulations cosmétiques sont, d'une façon générale, destinées à
 apporter à la peau des substances susceptibles d'améliorer son état ou de la
 10 protéger.

Ces substances sont, d'une façon générale, des substances hydratantes,
 protectrices, régulatrices, nutritives, etc. Elles sont de nature chimique très variée
 et peuvent être soit plutôt hydrosolubles, soit plutôt liposolubles.

On connaît tout l'intérêt des phospholipides, en particulier des
 15 phospholipides naturels tels que ceux que l'on trouve dans les lécithines, pour
 certains types de formulations cosmétiques telles que les dispersions de liposomes.
 On connaît, par ailleurs, des émulsions de triglycérides stabilisées par de la
 lécithine.

Tous ces produits laissent bien souvent sur la peau un toucher jugé
 20 trop gras lors d'applications dans le domaine de la cosmétique.

Les cyclométhicones sont des composées cycliques de type
 diméthylpolysiloxane répondant à la formule générale :



25

dans laquelle n présente une valeur moyenne comprise entre 3 et 6.

Les produits de la famille des cyclométhicones sont particulièrement
 connus dans le domaine de la cosmétique pour leur qualité de toucher cosmétique
 lors de l'application sur la peau. Toutefois, ces produits présentent l'inconvénient
 30 de ne pas former facilement des émulsions stables avec l'eau.

On a maintenant découvert que, de façon tout à fait inattendue, les
 produits de la famille des cyclométhicones, à condition d'être mélangés à un autre

produit hydrophobe choisi parmi les hydrocarbures liquides et les esters liquides d'acide gras et d'alcool gras, pouvaient conduire à des émulsions stables avec l'eau en présence de phospholipides naturels, en particulier de lécithines.

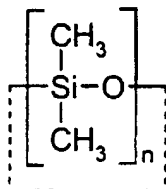
Les émulsions ainsi formées s'avèrent particulièrement stables et
5 présentent d'excellentes qualités cosmétiques.

Un avantage supplémentaire de telles émulsions est qu'elles peuvent être utilisées pour véhiculer dans la peau des actifs cosmétiques ou dermatologiques aussi bien hydrosolubles que liposolubles.

Une des caractéristiques essentielles des compositions décrites dans ce
10 document est qu'elles sont sous forme d'émulsions. C'est pourquoi on les désignera ci-après indifféremment par émulsions ou compositions.

Ainsi, selon un premier aspect, l'invention concerne une composition cosmétique ou dermatologique pour application topique sous forme d'émulsion de type eau-dans-huile, caractérisée en ce qu'elle contient, exprimé en pourcentage en
15 poids :

- 1 à 50 %, de préférence 3 à 20 %, d'une cyclométhicone répondant à la formule générale :



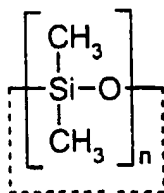
20 dans laquelle n est compris entre 3 et 6 et de préférence égal à 4 ou 5, ou d'un mélange de cyclométhicones,

- 0,5 à 30 %, de préférence 1 à 15 %, d'un hydrocarbure liquide en C₆ à C₄₀, d'un ester liquide d'acide gras et d'alcool gras ou d'un mélange de tels hydrocarbures et/ou esters,

25 - 1 à 50 %, de préférence 4 à 30 %, d'un phospholipide naturel ou d'un mélange de phospholipides naturels,

- 40 à 90 %, de préférence 60 à 90 %, d'eau.

Comme on l'a vu précédemment, les cyclométhicones sont des diméthylsiloxanes cycliques répondant à la formule générale :



dans laquelle n a une valeur moyenne comprise entre 3 et 6. Toutefois, pour la
préparation des émulsions de l'invention, on choisira avantageusement les
5 cyclométhicones dans lesquelles n présente une valeur moyenne de 4 ou 5.

L'hydrocarbure ou les hydrocarbures liquides utilisés éventuellement
dans la préparation des émulsions définies ci-dessus pourra être tout hydrocarbure
liquide en C₆ à C₄₀ ou tout mélange de tels hydrocarbures liquides. On choisira
avantageusement un hydrocarbure saturé qui pourra être linéaire dans le cas des
10 hydrocarbures les plus légers, dès l'instant où cet hydrocarbure est liquide. Cet
hydrocarbure pourra être également un hydrocarbure ramifié, ce qui est
indispensable pour les hydrocarbures les plus lourds. A titre d'exemples
d'hydrocarbures utilisables, on citera l'isododécane.

Par esters liquides d'acide gras et d'alcool gras, on entend, au sens de
15 l'invention, des esters liquides présentant des chaînes d'acide et d'alcool contenant
de 8 à 30 atomes de carbone.

Lorsque la composition de l'invention contiendra de tels esters
liquides, ils seront avantageusement choisis parmi les esters liquides d'alcools gras
et d'acides gras naturels. On choisira avantageusement l'huile de jojoba. On pourra
20 toutefois également choisir l'huile de jojoba synthétique.

Comme phospholipide ou mélange de phospholipides, on pourra
utiliser tout phospholipide naturel. On utilisera toutefois de préférence la lécithine
de soja ou la lécithine d'oeuf.

On a remarqué que l'on améliorerait encore la stabilité de l'émulsion
25 lorsque les proportions de cyclométhicones et d'hydrocarbures et d'esters d'acides
et d'alcools gras sont telles que les hydrocarbures et les esters d'acides et d'alcools
gras représentent au moins 30 % en poids par rapport à la cyclométhicone ou au
mélange de cyclométhicones.

La phase aqueuse de l'émulsion de l'invention contient
30 avantageusement au moins un alcool en C₂ à C₆ ou un polyol en C₂ à C₆ ou encore
un mélange de tels alcools et polyols. A titre d'alcools ou polyols préférés en C₂ à
C₆, on citera l'éthanol, le propanol, le propylèneglycol, le butylèneglycol, le

glycérol et le sorbitol. Ces alcools et/ou polyols et/ou mélanges d'alcools et de polyols, lorsqu'ils sont introduits dans les émulsions de l'invention représentent de préférence de 0,1 à 15 %, de préférence de 1 à 5 % en poids par rapport au poids total de l'émulsion.

5 L'émulsion peut contenir en outre de 0,1 à 10 % en poids d'un autre composé hydrophobe ou d'un mélange d'autres composés hydrophobes, lesdits autres composés hydrophobes étant choisis parmi les cires, les huiles végétales, les triglycérides d'acides gras et les stérols.

10 Enfin, les émulsions de l'invention pourront contenir différents adjuvants tant hydrophiles que lipophiles classiquement utilisés dans les compositions cosmétiques ou dermatologiques.

Ainsi, les émulsions de l'invention pourront contenir avantageusement :

- de 0,1 à 1 % en poids d'additifs choisis parmi les conservateurs, les
- 15 bactéricides et les fongicides,
- de 1 à 5 % en poids d'un filtre UV ou d'un mélange de filtres UV,
- de 0,1 à 5 % en poids de parfums,
- de 1 à 10 % en poids de particules solides choisies parmi les pigments, les micropigments et les charges minérales.

20 L'intérêt des émulsions de l'invention est essentiellement qu'elles peuvent être utilisées pour véhiculer dans la peau des substances aussi bien hydrophobes qu'hydrophiles.

Les substances hydrophiles ou hydrophobes visées peuvent être tout agent cosmétique ou dermatologique soluble dans l'eau, dans les hydrocarbures ou

25 dans des huiles.

L'invention vise tout particulièrement des compositions cosmétiques ou dermatologiques sous forme d'émulsions telles que définies précédemment et contenant, en outre, 0,001 à 5 % en poids d'agents actifs cosmétiques ou dermatologiques choisis parmi les agents cosmétiques ou dermatologiques

30 solubles dans l'eau, ou dans les hydrocarbures ou dans les huiles.

A titre d'exemples non limitatifs de substances actives cosmétiques ou dermatologiques, on citera tout particulièrement celles choisies dans le groupe constitué des vitamines et dérivés de vitamines, des oligo-éléments, des acides aminés, des céramides, des stérols, de l'acide rétinoïque, des ecdystéroïdes tels que

35 la 20-hydroxyecdysone, de l'acide β -glycyrrhétinique, du glycyrrhizinate d'ammonium, de l'hydroquinone et de ses dérivés, de l'acide kojique, de l'urée, du

pyroglutamate de sodium, des triterpènes, des ginsenosides, des dérivés des acides asiatique et madécassique, du séricoside, de la visnadine, de la caféine, des mono- et diméthylxanthines, des extraits végétaux, des extraits d'algues, des extraits de levures, des extraits de bactéries, des extraits de champignons, de la mélatonine, de la DHEA, des protéines, des alcools gras, des sucres, des α -hydroxyacides, des huiles essentielles, du panthénol, de l'acide salicylique.

Enfin, selon un deuxième aspect, l'invention concerne un procédé de préparation des compositions sous forme d'émulsions telles qu'elles ont été définies précédemment.

10 Selon ce procédé :

- on réalise un premier mélange comprenant le ou les phospholipides, les hydrocarbures et les esters liquides d'acides et d'alcools gras,

- on ajoute dans ledit mélange les différents adjuvants hydrophobes de la formulation,

15 - on ajoute ensuite la cyclométhicone ou le mélange de cyclométhicones,

- on disperse éventuellement les pigments dans le mélange,

pour préparer une première phase dite phase hydrophobe A,

20 - on dissout, le cas échéant, les constituants hydrophiles de ladite émulsion dans l'eau pour former une phase aqueuse, dite phase aqueuse B,

- on ajoute la phase aqueuse B dans la phase hydrophobe A.

EXEMPLES

25 Les compositions cosmétiques dont la formulation est donnée dans les exemples ci-après dans lesquels les proportions des différents constituants sont exprimées en pourcentages en poids sont préparées en suivant le mode opératoire suivant :

30 Phase A :

1) On mélange en agitant ou en malaxant la lécithine avec les hydrocarbures ou les esters liquides d'acides gras et d'alcool gras.

2) On rajoute à ce mélange en agitant ou en malaxant les différents adjuvants hydrophobes de la formulation.

35 3) On ajoute à ce mélange en agitant, la quantité prévue de cyclométhicone.

4) Eventuellement on disperse les pigments dans ce mélange.

Phase B :

5) On dissout dans la quantité d'eau prévue les constituants hydrophiles de la formule (conservateurs, polyols, produits à activité cosmétique ou dermatologique).

6) On ajoute, lentement, sous agitation, la phase aqueuse B dans la phase hydrophobe A réalisée en 3) ou en 4).

10 Exemple 1 : Produit pour peaux sèches

Phase A :

	Isododécane	4,3
	Lécithine d'oeuf	4
	Vitamine F	0,4
15	Cyclométhicone (n = 4)	10,8
	Parfum	0,5

Phase B :

	Glycérol	2
20	Sorbitol	2
	Urée	0,5
	Pyroglutamate de sodium	0,5
	20-hydroxyecdysone	0,1
	Parahydroxybenzoates	0,5
25	Eau	qsp 100

Exemple 2 : Produit pour peaux sensibles

Phase A :

	Isododécane	6
30	Lécithine de soja	12
	Acide bêta-glycyrrhétinique	0,2
	Cyclométhicone (n = 4)	12
	Parfum	0,4

35 Phase B :

	Glycérol	3
--	----------	---

	Phosphate de vitamine E	0,1
	Extrait butylèneglycolique de Phélorodendron amureuse	2
	Parahydroxybenzoates	0,5
5	Eau	qsp 100

Exemple 3 : Crème antiviellissement

Phase A :

	Isododécane	6
10	Lécithine de soja	20
	Vitamine F	0,5
	Linoléate de tocophérol	0,5
	Palmitate de vitamine A	0,5
	Parfum	0,5
15	Cyclométhicone (n = 4)	12

Phase B :

	Glycérol	3
	Asiaticoside	0,3
20	Phosphate de vitamine C	0,5
	Parahydroxybenzoates	0,5
	Eau	qsp 100

Exemple 4 : Produit de dermatologie dépigmentant

25 Phase A :

	Isododécane	4,2
	Lécithine de soja	6
	Acide transrétinoïque	0,02
	Cyclométhicone (n = 4)	9,8

30

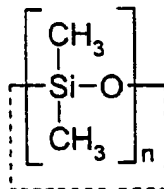
Phase B :

	Glycérine	2
	Hydroquinone	5
	Conservateurs p-hydroxybenzoates	0,5
35	Eau	qsp 100

REVENDEICATIONS

1. Composition cosmétique ou dermatologique pour application topique, sous forme d'émulsion de type eau-dans-huile, caractérisée en ce qu'elle comprend, exprimé en pourcentages en poids :

- 1 à 50 %, de préférence 3 à 20 %, d'une cyclométhicone répondant à la formule générale :



dans laquelle n est compris entre 3 et 6 et de préférence égal à 4 ou 5, ou d'un mélange de cyclométhicones,

- 0,5 à 30 %, de préférence 1 à 15 %, d'un hydrocarbure liquide en C₆ à C₄₀, d'un ester liquide d'acide gras et d'alcool gras ou d'un mélange de tels hydrocarbures et/ou esters,

- 1 à 50 %, de préférence 4 à 30 %, d'un phospholipide naturel ou d'un mélange de phospholipides naturels,

- 40 à 90 %, de préférence 60 à 90 %, d'eau.

2. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce que le(ou les) phospholipide(s) naturel(s) est(sont) choisi(s) parmi les lécithines, de préférence la lécithine d'oeuf ou de soja.

3. Composition selon l'une des revendications 1 ou 2, caractérisée en ce que les hydrocarbures et les esters d'acide et d'alcool gras représentent au moins 30 % en poids par rapport à la cyclométhicone ou au mélange de cyclométhicones.

4. Composition selon l'une des revendications 1 à 3, caractérisée en ce qu'elle contient en outre 0,1 à 15 % en poids, de préférence 1 à 5 %, d'un alcool ou d'un polyol en C₂ à C₆ ou d'un mélange de tels alcools et/ou polyols, lesdits alcools ou polyols étant de préférence choisis parmi l'éthanol, le propanol, le propylèneglycol, le butylèneglycol, le glycérol, le sorbitol.

5. Composition selon l'une des revendications 1 à 4, caractérisée en ce qu'elle contient en outre de 0,1 à 10 % en poids d'un autre composé hydrophobe ou d'un mélange d'autres composés hydrophobes, choisis parmi les cires, les huiles végétales, les triglycérides d'acide gras et les stérols.

6. Composition selon l'une des revendications 1 à 5, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre de 0,1 à 10 % d'additifs choisis parmi les conservateurs, les bactéricides et les fongicides.

7. Composition selon l'une des revendications 1 à 6, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre 1 à 5 % en poids d'un filtre UV ou d'un mélange de filtres UV.

8. Composition selon l'une des revendications 1 à 7, caractérisée en ce qu'elle contient en outre 0,1 à 5 % en poids de parfums.

9. Composition selon l'une des revendications 1 à 8, caractérisée en ce qu'elle contient en outre 1 à 10 % en poids de particules solides choisies parmi les pigments, les micropigments et les charges minérales.

10. Composition selon l'une des revendications 1 à 9, caractérisée en ce qu'elle contient en outre 0,001 à 5 % en poids d'agents actifs cosmétiques ou dermatologiques solubles dans la phase aqueuse ou la phase huile constituant ladite émulsion.

11. Composition selon la revendication 10, caractérisée en ce que lesdits agents actifs sont choisis dans le groupe constitué des vitamines et dérivés de vitamines, des oligo-éléments, des acides aminés, des céramides, des stérols, de l'acide rétinolique, des ecdystéroïdes tels que la 20-hydroxyecdysone, de l'acide β -glycyrrhétinique, du glycyrrhizinate d'ammonium, de l'hydroquinone et de ses dérivés, de l'acide kojique, de l'urée, du pyroglutamate de sodium, des triterpènes, des ginsenosides, des dérivés des acides asiatique et madécassique, du séricoside, de la visnadine, de la caféine, des mono- et diméthylxanthines, des extraits végétaux, des extraits d'algues, des extraits de levures, des extraits de bactéries, des extraits de champignons, de la mélatonine, de la DHEA, des protéines, des alcools gras, des sucres, des α -hydroxyacides, des huiles essentielles, du panthénol, de l'acide salicylique.

12. Procédé de préparation d'une composition selon l'une des revendications 1 à 11, caractérisé en ce que :

- on réalise un premier mélange comprenant le ou les phospholipides, les hydrocarbures et les esters liquides d'acides et d'alcools gras,
- on ajoute dans ledit mélange les différents adjuvants hydrophobes de la formulation,
- on ajoute ensuite la cyclométhicone ou le mélange de cyclométhicones,

- on disperse éventuellement les pigments dans le mélange,
pour préparer une première phase dite phase hydrophobe A,

- on dissout, le cas échéant, les constituants hydrophiles de ladite
émulsion dans l'eau pour former une phase aqueuse, dite phase aqueuse B,

5

- on ajoute la phase aqueuse B dans la phase hydrophobe A.

INSTITUT NATIONAL

de la

PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE

RAPPORT DE RECHERCHE
PRELIMINAIREétabli sur la base des dernières revendications
déposées avant le commencement de la rechercheN° d'enregistrement
nationalFA 556659
FR 9804543

DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		Revendications concernées de la demande examinée
Catégorie	Citation du document avec indication, en cas de besoin, des parties pertinentes	
X	EP 0 608 989 A (THE PROCTER & GAMBLE CO.) 3 août 1994 * revendications 1-14; exemple VI *	1-12
X	EP 0 526 289 A (L'OREAL) 3 février 1993 * revendications 18-21; exemple 3 *	1-12
X	US 5 310 556 A (P. ZIEGLER) 10 mai 1994 * le document en entier *	1-12
X	BASE DE DONNÉES "CHEMICAL ABSTRACTS" (SERVEUR: STN): Abrégé 125: 95 549, Columbus, OH, USA; & JP 08 127 519 A (SHISEIDO CO., Ltd) 21 MAI 1996 XP002089933 * le document en entier *	1-12
X	EP 0 661 035 A (L'OREAL) 5 juillet 1995 * revendications 1-20; exemple 3 *	1-12
E	US 5 738 859 A (R. POSNER) 14 avril 1998 * le document en entier *	1
A	US 5 690 918 A (T. JACKS ET AL.) 25 novembre 1997 * revendication 1 *	1
		DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHES (Int.CL.8)
		A61K
Date d'achèvement de la recherche		Examineur
13 janvier 1999		Glikman, J-F
<p>CATÉGORIE DES DOCUMENTS CITES</p> <p>X : particulièrement pertinent à lui seul Y : particulièrement pertinent en combinaison avec un autre document de la même catégorie A : pertinent à l'encontre d'au moins une revendication ou arrière-plan technologique général O : divulgation non-écrite P : document intercalaire</p> <p>T : théorie ou principe à la base de l'invention E : document de brevet bénéficiant d'une date antérieure à la date de dépôt et qui n'a été publié qu'à cette date de dépôt ou qu'à une date postérieure. D : cité dans la demande L : cité pour d'autres raisons & : membre de la même famille, document correspondant</p>		

1

EPO FORM 1503 03.92 (P04C13)